

第3部門第2区分

(43)公表日 平成6年(1994)6月16日

(51)Int.Cl.⁸
A 01 N 57/20識別記号 庁内整理番号
G 9159-4H

F 1

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 19 頁)

(21)出願番号 特願平4-505681
 (86) (22)出願日 平成4年(1992)1月15日
 (85)翻訳文提出日 平成5年(1993)7月23日
 (86)国際出願番号 PCT/US92/00274
 (87)国際公開番号 WO92/12637
 (87)国際公開日 平成4年(1992)8月6日
 (31)優先権主張番号 645,365
 (32)優先日 1991年1月24日
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 804,592
 (32)優先日 1991年12月13日
 (33)優先権主張国 米国(US)

(71)出願人 モンサント・カンパニー
 アメリカ合衆国、ミズーリ・63167、セント・ルイス、ノース・リンドバーグ・ブルバード・800
 (72)発明者 ブリル, アーハード・ジョン
 アメリカ合衆国、ミズーリ・63122、カーグウッド、ロケット・レイン・1215
 (72)発明者 リチヤードソン, ロナルド・オーエン
 アメリカ合衆国、ミズーリ・63011、エリスピル、フィールド・アベニュー・1231
 (74)代理人 弁理士 川口義雄(外2名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 改良されたグリホセート処方物

(57)【要約】

本発明は、雑草を枯死又は制御する場合に用いるためのN-ホスホノメチルグリシンを含有する農業上許容可能な組成物、雑草の枯死又は制御方法、及びこれらの組成物の製造方法に関する。組成物はドライ且つ水溶性であって、N-ホスホノメチルグリシン、酸受容体及び任意に固体又は液体界面活性剤を含有する。

請求の範囲

- 除草剤的有效量の実質的に未反応のヨーホスホノメチルグリシン及び感受性を含有する実質的にドライな、水溶性またはドライな、水分散性の農業上許容可能な組成物。
- 約0.2～約15.0重量%の量で固体又は液体界面活性剤をさらに含有する請求項1記載の組成物。
- 上記ドライ組成物が水溶性又は水分散性粉末、水溶性又は水分散性顆粒、水溶性又は水分散性酸剤あるいは水溶性又は水分散性塩である請求項2記載の組成物。
- 上記ドライ組成物中の水の量が全組成物の約0.01～約1.0.0重量%の範囲である請求項1記載の組成物。
- 上記ドライ組成物中の水の量が全組成物の約0.2～約2.0重量%の範囲であって、上記組成物が顆粒形態である請求項4記載の組成物。
- 上記感受性がアンモニウム及びアルカリ金属硫酸塩、重碳酸塩、酢酸塩、メタホウ酸塩、クエン酸塩、磷酸塩、シウ酸塩、リン酸塩、プロピオン酸塩、ピロリン酸塩、メタケイ酸塩、オルトケイ酸塩、亜硫酸塩、チオ硫酸塩、テトラホウ酸塩、

トリポリリン酸塩、メタリン酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、四ナトリウムEDTA、及びその混合物からなる群から選択される請求項1記載の組成物。

- さらに補助除草剤を含有する請求項1記載の組成物。
- さらに分散剤又は腐食防止剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらに増粘剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらにカルシウムイオン封鎖剤及び/又は消泡剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらに農業上許容可能なアンモニウム塩又は他の共鳴剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらに急速燃焼抑制剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらに湿润剤を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- さらに染料又は顔料を含有する請求項1又は7記載の組成物。
- 上記補助除草剤が水溶性塩を形成する請求項6又は7記載の組成物。
- 上記補助除草剤が、2,4-D(2,4-ジクロロフェノ

キシ酸)、ジカンバ、(3,6-ジクロロ-2-アニス酸)、ピクロラム(4-アミノ-3,6,6-トリクロロピリジン-2-カルボン酸)、MCPA(4-クロロ-2-トリロキシ酸)、ピアラフォス(DL-ホモアラニン-4-イル-メチルホスフィニート)、イマダクイン、(2-[4,5-ジヒドロ-4-メチル-4-(1-メチルエチル)-5-オキソ-1H-イミダゾール-2-イル]-3-キノリンカルボン酸)、ダラボン(2,2-ジクロロプロピオン酸)、ジクロールプロップ2-(2,4-ジクロロフェノキシ)プロピオン酸)、MCPB(4-(4-クロロ-2-トリロキシ)酸)、アシフルオルフェン(5-(2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ-2-ニロトベンゾエート)、クロラムベン(3-アミノ-2,5-ジクロロ安息香酸)、エンドタール(7-オキサビシクロ(2,2,1)ヘプタン-2,3-ジカルボン酸)、2,4,5-T(2,4,5-トリクロロ酢酸)、2,3,6-TBA(2,3,6-トリクロロ安息香酸)、グルホシネート-アンモニウム(3-アミノ-3-カルボキシプロピル)-メチルホスフィニート)、イマダビル(2-[4,5-ジヒドロ-4-メチル-4-(1-メチルエチル)-5-オキ

ソ-1H-イミダゾール-2-イル]-3-ビリジンカルボン酸)、及びその混合物からなる群から選択される請求項7記載の組成物。

- 上記補助除草剤が本質的に水不溶性である請求項7記載の組成物。
- 上記水不溶性補助除草剤が微細粉末として上記水分散性組成物中に存在する請求項17記載の組成物。
- 上記水不溶性補助除草剤が水分散性顆粒として上記組成物中に存在する液体又は固体であって、アラクロール(2-クロロ-2',6'-ジエチル-N-メトキシメチルアセトアニリド)、アトラジン(2-クロロ-4-エチルアミノ)-6-(イソプロピルアミノ)-6-トリアジン、シマジン(6-クロロ-N,N'-ジエチル-1,3,6-トリアジン-2,4-ジアミン)、アセトクロール(2-クロロ-2'-エチル-6'-メチル-N-エトキシメチルアセトアニリド)、メトラクロール(2-クロロ-6'-エチル-N-(2-メトキシ-1-メチルエチル)アセト-2-オルイジド)、ホタサフェン(5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-N-(メチルスルホニル)-2-ニトロベンザミド)、

オキシフルオルフェン（2-クロロ-1-(3-エトキシ-4-ニトロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン)、フェノキサブロップ-エチルエチル-2、[4-(6-クロロ-2-ベンゾキサゾリルオキシ)フェノキシ]プロパンエート)、クロン(4-(3、4-ジクロロフェニル)-N、N-ジメチルウレア)、メトスルフロン-メチル(メチル-2-[[(4-メトキシ-8-メチル-1、3、5-トリアゾン-2-イル)アミノ]カルボニル]アミノ]スルホニル)安息香酸塩)、クロリムロン-エチル-エチル-2-[[(4-タロロ-6-メトキシピリミン-2-イル)アミノ]カルボニル]アミノ]スルホニル]安息香酸塩)、リタロン-3-(3、4-ジクロロフェニル)-1-メトキシ-1-メチルウレア)、スルホメツロン-メチル(2-[3-(4、6-ジメチル-ピリミン-2-イル)ウレイドスルホニル]安息香酸)、クロルスルフロン(1-(2-タロロフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1、3、5-トリアゾン-2-イル)ウレア)、及びその混合物から選択される請求項17記載の組成物。

20. 水溶性塩としての上記補助草剤が請求項1記載の上記組成物と配合される請求項7記載の組成物。

21. 上記界面活性剤が非イオン性界面活性剤、陰イオン性界面活性剤、陽イオン性界面活性剤、兩性界面活性剤、又はその混合物を包含する請求項1記載の組成物。

22. 上記非イオン性界面活性剤がポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックポリマー、アルキルフェノールポリオキシエチレンステール、ポリオキシエチレンオレイルエチル、又はその混合物である請求項21記載の組成物。

23. 上記陰イオン性界面活性剤がナトリウムテウリル硫酸塩、ナトリウムアルファ-オレフィンスルホン酸塩、カリウムアルファ-オレフィンスルホン酸塩、ナトリウムアルカンスルホン酸塩、カリウムアルカンスルホン酸塩、アンモニウムアルカンスルホン酸塩、イソプロピルアンモニウムアルカンスルホン酸塩、ナトリウムアルキル又はジアルキルテフタレンスルホン酸塩、あるいはその混合物である請求項21記載の組成物。

24. 上記陽イオン性界面活性剤が、エトキシ化脂肪アミン、アンモニウムオキシド、例えばラウリルジメチルアミノオキシド、N、N-ビスヒドロキシエチルココアミノオキシド、プロポキシ化第四アンモニウム化合物、又はその混合物である請求項21記載の組成物。

記載の組成物。

25. N-ホスホノメチルグリシンが、アンモニウム、イソプロピルアミン、トリメチルスルホニウム、イミノウレア、カリウム、ナトリウム塩、又その混合物からなる粉から選択される水溶性塩の形態である請求項1記載の組成物。

26. 請求項25記載の上記組成物を含有し、さらに硫酸アンモニウム、硫酸カリウム、塩化カリウム、硫酸ナトリウム、ウレア、その混合物等を含有するドライ水溶性組成物。

27. 各成分-N-ホスホノメチルグリシン、吸収媒体、任意に固体又は液体界面活性剤を混合し、その後上記混合物成分を配合して上記組成物を生成するか、又は上記組成物を圧縮又は乾燥化して固形を生成することからなるドライな水溶性の農業上許容可能な組成物の製造方法。

28. 枯死又は制御すべき植物又は雑草の場所に除草剤的有効量のグリキセートを適用することによる請求項1記載の組成物を用いた雑草の枯死又は制御方法。

29. 補助草剤が上記N-ホスホノメチルグリシン、上記吸収媒体及び任意に上記固体又は液体界面活性剤と配合される請求項28記載の方法。

30. さらに上記組成物を被膜、粉、粉末又は顆粒あるいはその混合物の形態で水と混合し、枯死又は制御すべき植物又は雑草の場所に除草剤的有効量のグリキセートを適用することからなる請求項29の雑草の枯死又は制御方法。

31. 請求項1記載の組成物を有する被膜、粉、粉末又は顆粒。

32. 水溶性であり、長さ約2インチ(5、08センチメートル)×幅約1/2インチ(1、27センチメートル)×厚さ約1/2インチ(1、27センチメートル)である請求項31記載の被膜。

明細書

改良されたグリホセート塩方物

産業上の利用分野

本発明は、N-ホスホノメチルグリシン又はその塩を含有する実質的にドライな農業上許容可能な組成物、雑草の枯死又は制御に關してのこのような組成物の使用、及びこのような組成物の製造方法に関する。

グリホセート（N-ホスホノメチルグリシン）は實質的な除草剤として當量界で十分公知である。有機酸であるグリホスフェートは、本に少しだけ溶解する。グリホセートは一般に商業的に給方され、本性塩として、特にイソプロピルアミン塩（IPA塩）として用いられる。

グリホセートの個々の給方物、グリホセートの塩、グリホセートの塩の製造方法及びその使用方法は、米国特許第3,799,758号及び第4,405,531号（それぞれ1974年3月26日及び1983年9月20日にJohn B. Frankに對して発行）に開示されている。グリホセートの塩を開示する他の米国特許としては、米国特許第4,315,765号（1982年2月16日にGeorge

B. Largeに對して発行）、米国特許第4,507,260号（1985年3月26日にIshak Bakelに對して発行）、米国特許第4,397,676号（1983年8月9日にIshak Bakelに對して発行）、米国特許第4,481,026号（1984年11月6日にMichael P. Presbyllに對して発行）、米国特許第4,140,513号（1979年2月20日にBerhard J. Prillに對して発行）が挙げられる。

Aikaloida Vegyessetに開示されたハンガリー特許出願第431/88号は、水溶性植物成長制御固体活性剤N-ホスホノメチルグリシン及びその誘導体を膨脹塩及び成膜水溶性塩と、並びに適例の植物保護顕加剤と混合物することを開示する。十分な開始水を添加して、これらの化合物間の複分解反応の程度を管理する。得られた固体をコロイド化学的手法で泡、クリーム、懸液、粉末、顆粒又は圧縮物として包装される農業農薬粉末に変換する。

Wellcome Foundation Limitedに開示され、1984年12月12日に公開された歐州特許出願第0,127,773 A1号は、殺虫剤、殺虫剤のための

乳化剤又は分散剤、及び水との接触時に泡起又は膨潤可能な自己崩壊剤を含有する殺虫剤組成物を開示する。本組成物は、起泡性殺虫剤組成物の形態が便利であると開示されている。

1982年10月6日に公開された英國特許出願第2,085,556 A号は、殺生物剤ホルムアルデヒドを生成するプロ殺生物剤、二酸化炭素を発生するための泡起カッブル、及び任意に界面活性剤を含有する組成しない殺生物の存在を制御するための組成物を開示する。

Kirby Pharmaceuticals Limitedに開示され、1978年8月30日に公開された英國特許明細書第1,505,738号は、化学化合物、アルカリ金属電導塩、アルカリ金属炭酸塩及び固体の水溶性固体酸カルボン酸又はその塩を含む粉末を直接圧縮法により組成物に直接加圧することを包含する起泡剤形態で混合された水溶性化学組成物の製造方法を開示する。

SOGEMARICに開示され、1978年7月5日に公開された英國特許明細書第1,518,682号は、固体形態で、即ちそれが固体である場合には活性物質單独で、あるいはそれが液体である場合には固体の不活性支持体上に含浸させた1つ

又はそれ以上の活性物質兩生物質（除草剤、成長調節剤、殺虫剤、殺カビ剤）を水溶性粉末の製造に一般的に用いられる膨脹の添加剤、膨脹剤、分散剤と、そしてその明細書に記載の非親水性充填剤及び界面活性剤と混合される混合物を開示する。混合物を均質化し、次に50~1000 kg/cm²の範囲の圧力下で、好みしくは100~600 kg/cm²の範囲の圧力下で必要な形態の顆粒又はペレットに圧縮する。

デュポン（DuPont）PCT/US89/0272は、約100℃で溶融し、約5%以下の水溶解度を有する本質的に約20~75%の殺虫剤から成る顕剤、並びに本質的に二極基性又は三極基性有機カルボン酸、アンモニウム又はアルカリ度塩又は重炭酸塩、分散剤、PVP及び陰イオン又は陽イオン性界面活性剤から成り、それにより水中の殺虫剤の分離が50メッシュスクリーンを通過するのに十分に細かくなる送り出系を開示する。

チバガイギー（Ciba-Geigy）AU-A-59042/90は、水中で崩壊して噴霧可能な顕剤を生じ、本質的に水不溶性活性成分、界面活性剤、充填剤及び結合剤、洗浄剤及び崩壊剤から成る起泡性顕剤形態の殺虫剤活性成

分離物であって、脱酸カリウム及び/又は脱酸水素カリウム、固体水溶性酸性物質及び水を結合し得る兼性水不溶性物質から成る泡性颗粒の形態で防腐剤を含有する濃縮物を示す。

デュポン (DuPont) EPO特許出願第0, 360, 441号は、水溶性颗粒及び水分性颗粒組成物を示す。それによりグリセートが脱酸カリウムとともに粒状基質として開示される。

チバガイギー (Ciba Geigy) U-A-25886/88は、スルホニルウレア、分散剤及び防腐剤を含有し、さらに固体水溶性酸性物質、アルカリ/アルカリ土重金属ノ脱酸水素塩、着色又は流動調節剤及び任意に充填剤又は結合剤を含有する泡性压縮殺虫剤を示す。

Rhone Poulenの英国特許明細書第2, 104, 780 A号は、脱酸草剤又は植物成長調節剤、アルカリ脱酸塩/活性脱酸塩、除草剤活性添加物からの不純物及び界面活性剤又は表面の水溶性颗粒であるといわれる泡性除草剤颗粒を示す。

EPO特許出願公開第0, 204, 146号は、(a) 2-(4-クロロ-2-フルオロー-5-プロパルギルオキシフェニ

ル)-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1H-1, 2, 4-トリアゾロ(1, 2-ε)ピリダジン-1, 3, -2H-ゾン(1)を(b)グリセート(1)グリコシネット(1)ピアラホス(111)及び/又はバラクアト(1, 1'-ジメチル-4, 4'-ビビリクニウムイオン)(1v)又はそれらの塩及び不活性キャリアー又は着色剤とともに含有する除草剤組成物を示す。

EPO特許出願公開第0, 255, 700号は、酸性物質、陰イオン性界面活性剤及び任意に1つ又はそれ以上の酸加剤の混合物を濃縮溶液又は水性スラリーの形態で乾燥塔の上部に導入することにより開示される粒状風乾草剤組成物を示す。

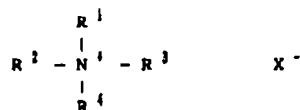
日本国特許出願公開第0, 62175407号及び第0, 62175408号は、固体キャリアー、酸加剤及び除草剤成分を含有し、48~150メッシュの粒子サイズを有する除草剤を示す。開示除草剤成分は、(3-アミノ-3-カルボキシ)プロピル-1)メチル-ホスキン酸、N-ホスホノメチルグリシン、(2-アミノ-4-メチルホスフィノ-ブチラ)アラニルアラニン及びその塩である。

欧洲特許出願第0, 206, 587号は、植物活性N-

ホスホノメチル-3-カルボキシメチル化合物と直結で固体である界面活性剤との均質混合物を含有する固体の、実質的に非吸湿性の植物活性組成物を示す。

欧洲特許出願第0, 256, 608号は、(a)環形態の植物活性N-ホスホノメチル-N-カルボキシメチル化合物を酸アミンと反応させて上記N-ホスホノメチル-N-カルボキシメチル化合物のアミン塩を生成し、(b)上記N-ホスホノメチル-N-カルボキシメチル化合物の上記アミン塩を均界面活性剤(周囲温度で固体である)と結合して、(c)上記混合物を界面活性剤の融点以下に冷却して、上記界面活性剤及びそのマトリックス中に介在分散したN-ホスホノメチル-N-カルボキシメチル化合物の上記アミン塩を含有する周囲温度で固体である組成物を生成することからなる固体植物活性組成物の製造方法を示す。

国際特許第WO 87/04595号は、グリセートのナトリウム塩及び次式:



(式中、R¹及びR²は独立してメチル又はエチルであり、R³はメチル、エチル、ペンジル又はC₁₀~C₁₁アルキルであり、R⁴はC₁₀~C₁₁アルキルであり、Xはクロロ又はブロモである)を有する界面活性剤を含有する除草性水溶性ドライゼグリセート処方物を示す。

日本国特許公開145, 205-88号は水溶性グリセート塩、硫酸アンモニウム及び第四アンモニウム塩を含有する水性濃縮除草剤処方物を示す。

PCT/WO 8704712は、固体アルカリ金属塩を保持しながら25%までの水を含有するN-ホスホノメチルグリシンに添加することからなるN-ホスホノメチルグリシンの粒状アルカリ金属塩の製造方法を示す。

1986年11月付けの研究報告書は、刊行物27161で、N-ホスホノメチルグリシン、非イオン性界面活性剤、ケイ酸土、糊精(硫酸アンモニウム)及び消泡剤を含有する糊精の割合に有効な植物性粉末処方物を示す。

Chemical Abstracts 103:

191395k (1985) グリセートの調整。

Davydov, A. M.; Vechtomova, T. N.;

Basunova, G. G. (USSR), Zashch. Rast. (Moscow) 1985, (9), 40-1 (Russia) は、36%水溶性液体 (I) [96638-41-4] 及び 50%粉未 Fosfidea (II) (これらはグリセートのリビエトの商標である) を示す。

本発明の要約

本発明は、実質的に未反応の N-ホスホノメチルグリシン、吸収剤及び任意に固体及び/又は液体界面活性剤を含有する実質的にドライな、水溶性または分散性の農業上許容可能な組成物を包含する。任意の液体界面活性剤は、存在する場合は好ましくは約 0.2~約 1.5.0 重量%、さらに好ましくは 0.2~1.0 重量%であるが、他の始方成分によってはさらに多量の任意の液体界面活性剤を用いてよい。

農業上許容可能なという用語は、自家所有者、及びアパート領域、並びに使用すると便利な工業、住宅及びその他の同様の領域における本発明の組成物の使用を含む。

本発明の組成物はさらに、硫酸アンモニウム、アルカリ金属硫酸塩、例えば硫酸カリウム、硫酸ナトリウム、アルカリ金属塩化物、例えば塩化カリウム、ウレア、その混合物等を任意に

含有する。組成物は任意に、相乗剤、急速燃焼剤、湿润剤、補助草剤、染料、顔料、腐食防止剤、増粘剤、分散剤、カルシウムイオン封鎖剤、その混合物等を含有する。

本発明の組成物の製造方法においては、実質的にドライな水溶性の農業上許容可能な組成物は、実質的に未反応の N-ホスホノメチルグリシン及び吸収剤、並びに任意に固体又は液体界面活性剤を、任意に鉛錆硫酸アンモニウムと一緒に混合し、その後配合し、例えばこれらを示した成分及び任意の部分を逐次揮出することにより乾燥化し、圧縮し、液化し、又は颗粒化し、本発明の組成物を生成する。

本発明の目的

本発明の目的は、自家所有者及び住居市場を含めた使用のためのドライ水溶性農業上許容可能なグリセート組成物を提供することである。

本発明の目的は、任意に界面活性剤を含有するドライ水溶性粉未又は粒状農業上許容可能な組成物の製造方法を提供することである。

本発明の別の目的は、実質的にドライな水溶性農業上許容可能な組成物を用いて雑草を枯死及び抑制するために用いる除草

方法を提供することである。

古くに本発明の目的は、低成本で輸送できて、除草活性成分 (N-ホスホノメチルグリシン、吸収剤、任意の界面活性剤) の含量を増大した、貯蔵安定性組成物を生成するために相溶的方法で種々の補助草剤と混合物を得る、そして所望により可燃性又はリサイクル可能な又は使い捨ての容器に包装できて、使用が容易である実質的にドライな水溶性農業上許容可能な組成物を提供することである。

これらの及び他の目的は、後述でさらに詳細に説明する本発明において達成される。

本発明の詳細な説明

本発明は、N-ホスホノメチルグリシン、吸収剤及び任意に固体又は液体界面活性剤を含有する実質的にドライな、水溶性 (好ましくは粉末又は顆粒の) 農業上許容可能な組成物を包含する。

実質的にドライな物質として、例えば粉末として調製する場合、粉末は一般的には約 50 メッシュ未満であって、約 0.01 重量%~約 1.0.0 重量%、好ましくは約 2 重量%未満であるがしかし 0.2 重量%以上の水を含むし、過剰される

地方法成分によりそれより多くても少なくともよい。

所望により、相乗剤、腐食防止剤、増粘剤、分散剤、カルシウムイオン封鎖剤、相乗剤、急速燃焼剤、湿润剤、補助草剤、顔料又は顔料を別々に又は混合的に組成物に混合物してもよい。

所望により、水溶性塩を生成するある種の補助草剤を用いてよい。このような補助草剤は、2,4-D (2,4-ジクロロフェノキシ酢酸)、ジカンバ (3,6-ジクロロ-6-アニス酸)、ピクロラム (4-アミノ-3,5,8-トリクロロ-6-オキシ-2-カルボン酸)、MCPA (4-クロロ-6-オキシ-2-カルボン酸)、グラボン (2,2-ジクロロプロピオニ酸)、ジクロールプロップ 2-(2,4-ジクロロフェノキシ) プロピオニ酸)、MCPB (4-[(4-クロロ-6-オキシ) 酸]、アシフルオルフェン (5-[(2-クロロ-4-(トリフルオロメチル) フェノキシ) -2-ニトロベンゾエート)、クロラムベン (3-アミノ-2,5-ジクロロ安息香酸)、エンドタール (7-オキサビシクロ (2,2,1) -ヘプタン-2,3-ジカルボン酸)、メコプロップ (2-(2-メチル-4-クロロフェノキシ) プロピオニ酸])、2,4-

5-T(2,4,5-トリクロロ酢酸)、2,3,6-TBA(2,3,6-トリクロロ安息香酸)、グルホシホート-アソニウム(3-アミノ-3-カルボキシプロピル)-メチルホスフィネット、イマザビル(2-[4,5-ジヒドロ-4-メチル-4-(1-メチルエチル)-5-オキソ-1H-イミダゾール-2-イル]-5-エチル-3-ピリジンカルボン酸)、イマザクイン(2-[4,5-ジヒドロ-4-メチル-4-(1-メチルエチル)-5-オキソ-1H-イミダゾール-2-イル]-3-キノリンカルボン酸)、ピアラファス(ロレキセオアラニン-4-イル-メチル-ホスフィネット)、及びその混合物等からなる群から選択し得る。

さらに新規により、グリホセート及び歯受容体(任意の界面活性剤)組成物中に含まれる歯形態の代わりに細胞膜活性剤を組成物に配合し得る。

本発明の組成物中に固体水不溶性細胞膜活性剤を用いるのが好ましい。その歯形態においては、細胞膜活性剤は量細粉末として組成物中に存在する:スルホニルウレア、例えばスルホメツロン-メチル(2-[3-(4,6-ジメチルビリミジン-2-イル)ウレイドスルホニル]安息香酸)、及びクロルスルフロン(1-

-2-クロロフェニルスルホニル)-3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアゾン-2-イル)ウレア)、ジウロン(N'-[3,4-ジクロロフェニル]-N,N-ジメチルウレア)、シマジン(2-クロロ-4,6-ビス(エチルアミノ)-5-トリアゾン)、メトスルフロン-メチル(メチル-2-[[(4-メトキシ-4-メチル-1,3,5-トリアゾン-2-イル)アミノ]-カルボニル]-アミノ]スルホニル]安息香酸)、クロリムロン-エチル(エチル-2-[[(4-クロロ-6-メトキシビリミジン-2-イル)アミノ]-カルボニル]-アミノ]スルホニル]安息香酸)、リヌロン(N-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メトキシ-メチルウレア)、アトラジン(2-クロロ-4-エチルアミノ)-6-(イソプロピルアミノ)-8-トリアゾン)、及びその混合物等。それは分散剤を含むのが望ましい。

例えば、水不溶性細胞膜活性剤は、水分散性顆粒として上記組成物中に液体又は固体で存在してもよい:アラクロール(2-クロロ-2',6'-ジエチル-N-メトキシメチルアセトニアリド)、アセトクロール(2-クロロ-2'-エチル-6'-メチル-N-エトキシメチルアセトニアリド)、アトラジン(2-

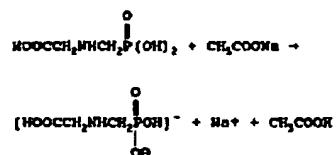
-クロロ-4-(エチルアミノ)-6-(イソプロピルアミノ)-8-トリアジン、メトラクロール(2-クロロ-6'-エチル-N-(2-メトキシ-1-メチルエチル)アセトロートルイジド)、ホメサフェン(5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-N-(メチル-スルホニル)-2-ニトロベンザミド)、オキシフルオルフェン(2-クロロ-1-(3-エトキシ-4-ニトロフェノキシ)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン)、フェノキサプロップ-エチルエチル-2-[4-(8-クロロ-2-ベンゾキサゾリルオキシ)フェノキシ]プロピオネート)、ジウロンN'-[3,4-ジクロロフェニル]-N,N-ジメチルウレア、メトスルフロン-メチル、シマジン-6-クロロ-N,N'-ジエチル-1,3,5-トリアジン-2,4-ジアミン、クロリムロン-エチル、リヌロン、クロルスルフロン、スルホメツロン-エチル及びその混合物等。

好適な歯受容体は、例えばアンモニウム及びアルカリ金属酸、重碳酸、重碳酸、メチホウ酸、酢酸、クエン酸、細胞膜、シウ酸、リン酸、プロピオン酸、ビロリン酸、メタケイ酸、オルトケイ酸、亜硫酸、チオ硫酸、テトラホ

ウ酸塩、一級リン酸塩、トリポリリン酸塩、メタリン酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、四ナトリウムEDTA、及びその混合物等からなる群から選択される。

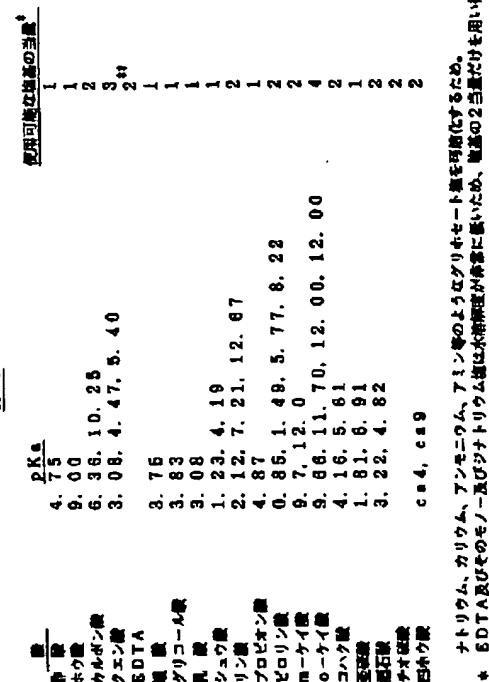
本発明においては、組成物は実質的に未反応のグリホセート(N-ホスホノメチルグリシン)、歯受容体及び任意に固体又は液体界面活性剤を含有する。液体界面活性剤は、十分な少量で存在する場合、又は大量の添加剤、例えば硫酸アンモニウムが存在する場合、又は高濃度酸キャリアー上に懸着される場合に用い得る。

歯受容体の例として、理論に待られずに、酢酸ナトリウムを用いると、グリホセート/酢酸ナトリウム混合物を水に溶解すると以下の反応が起きる。



グリホセートに関するpK_a値は2.27、5.58及び10.25である。塩基性塩がグリホセートを可溶化するのに

有用であるためには、2. 27より多少大きい pK_a 値を有する酸の組でなければならない。さらに、難細胞体、例えばシウ酸として抗腫瘍の場合を除いて、酸は水溶性である。多酸の酸の pK_a 値及びダリキセートを可溶化するためにそれらの塩（即ちナトリウム、カリウム、アンモニウム等）から用い得る量の回数を表 I に示す。



ナトリウム、カリウム、アンモニウム、アミン等のようなダリセーセート類を可溶化するため、EDTA及びそのモノ-及びナトリウム塩に水溶性が非常にいため、脂質の2倍だけを用い得る。

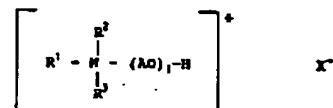
好適な界面活性剤（任意）としては、非イオン性界面活性剤、陰イオン性界面活性剤、陽イオン性界面活性剤及び両性界面活性剤、その混合物等、好ましくはN-ホスホノメチルグリシン又はその他の陰性界面活性を増大するものが挙げられる。

任量の非イオン性界面活性剤の例としては、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレンアルキルフェノール、ポリオキシエチレンオレイルエーテル、アルキルグリコシド、及びその混合物等が挙げられる。

任の陰イオン性界面活性剤の例としては、ナトリウム、カリウム及びアミン塩を含めたナトリウムラウリル硫酸塩、ナトリウムモノ-及びジーアルキルキルナフタレンスルホン酸塩、ナトリウムアルファ-オレフィンスルホン酸塩、ナトリウムアルキルベンゼンスルホン酸塩、ナトリウムアルカンスルホン酸塩、及びにその混合物等が挙げられる。

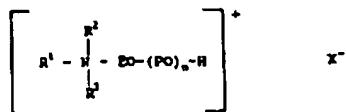
任意の陽イオン性界面活性剤の例としては、エトキシル化物防アミン及びそれに對応する第四塩、例えはエトキシル化タローアミン、エトキシル化オレイルアミン、エトキシル化ココアミン及びエトキシル化ソイアミン、及びその複合物等が挙げられる。

任の陽イオン性界面活性剤の例としては、プロポキシル化第四アンモニウム界面活性剤が挙げられる。このような界面活性剤は次式を有する：



(式中、A 又は各 A は 2 又は 3 個の親電子原子を有するアルキレン基を示し； R^1 及び R^2 は各々独立して 1 ～ 5 個の親電子原子を有するアルキル基であり； R^3 は 1 ～ 5 個の親電子原子を有するアルキル基であるか又は式 $(AO)_j - H$ を有する基であり； I (R^3 がアルキル基である化合物の場合) 又は $I + j$ (R^3 が式 $(AO)_j - H$ を有する基である化合物の場合) は 2 ～ 20 の値を有し； X^+ は肝毒な陰イオンである)。

本発明の好適な組成物は、グリホセート除草剤及び第四アンモニウム化合物を含有し、第四アンモニウム化合物は次式で示される構造を有する：



(式中、-EO-はエチレンオキシド基であり、-PO-はブロビレンオキシド基であり、R¹及びR²は各々独立して1～3個の炭素原子を有するアルキル基であり；R³は1～3個の炭素原子を有するアルキル基、式(EO)_n-Hを有する基、又は式EO-(PO)_n-Hを有する基であり、n(R³)がアルキル基である化合物の場合)又はn+m(R³)が式EO-(PO)_n-Hを有する基である化合物の場合)は2～20の値を有し；X⁻は好適な陰イオンであり、n及びmは各々独立して変化する整数である)。

任意の好適な両性界面活性剤の例は、モナテリクス、ミラノール、ペタイン、ロンザイン、及びその混合物等である。

N-ホスホノメチルグリシンの歴史上許容可能な好ましい例としては、アンモニウム、イソプロピルアミン、トリメチルスルホニウム、イミノケラア塩、ナトリウム、カリウム塩、及びその混合物等が挙げられる。

別の選択では、本発明の組成物はさらに、硫酸アンモニウム、

硫酸カリウム、塩化カリウム、硫酸ナトリウム、ウレア、その混合物等を含有し得る。所望により、組成物は溶剤を含有してもよい。

所望により、組成物はさらに、相変剤、急速発泡添加剤、温湯剤、被除草剤、染料、顔料、分散剤、潤滑防止剤、埋粘剤、カルシウムイオン封鎖剤、苦味剤、その混合物等を含有し得る。埋粘剤は一般に、ナトリウムリグニンスルフェート、でんぶん、セルロース錠等体、高分子ポリオキシエチレン、ゴム、及びその混合物等からなる群から選択される。

所望により、本発明のドライ水溶性農業上許容可能な組成物は、發酵成分、N-ホスホノメチルグリシン、農業等及び任意に固体又は液体界面活性剤を、任意に發酵酸アンモニウムと一緒に混合し、その後これらの成分を配合して上記の組成物を生成することからなる方法で調製し得る。任意に、配合成分を削減してもよい。配合操作後、還式酵母を実施し、その後任意の乾燥工程を実施する。

本発明はさらに、草が存在する場合に調製するとの同様に除草剤的有効量の本発明の組成物を枯死又は制御すべき植物又は雑草の場所に適用することにより雑草を枯死又は制御する方法

実験例

実施例1

例えば農業等を有し、任意の界面活性剤を用いる水溶性粉末(WSP)組成物を、予め50メッシュ以下にすり潰しておいた成分を配合して調製した。N-ホスホノメチルグリシン/任意の界面活性剤の重量比は2:1であった。それより高い又は低い比を用いてもよい。粗粒度より5%余分な農業等を通常用いる。本実施例の組成物を以下に示す。

を包含する。本発明の組成物の形態は、例えば直角性粉末を、あるいは序ましくは着脱水を加えて雑草に着脱組成物を噴霧するのに適している。

本発明の組成物の好ましい形状は、長さ約2インチ(5.1cm)×幅約1/2インチ(1.3cm)×厚さ約1/2インチ(1.3cm)であるが、所望によりそれより大きい又は小さいサイズを用いてもよい。好ましい重量は、約1～約3.6グラムの範囲である。

一般にポンプアップ型又は手動作型スプレーを用いて、本発明の着脱組成物を雑草又は植物に散布する。スプレーは序ましくは約1.2オンス(340グラム)の透明水で満たし、本発明の組成物を含有する緩衝剤を加える。緩衝剤を溶解させ(約1～3分)、次いでさらに水を加える(約1.2オンス(340グラム))。

以下の実施例で本発明及び本発明の組成物のいくつかを説明する。これらの実施例は所望の組成物及び除草剤的使用的説明であって、本発明の範囲を限定するものではない。

図表1

試験条件、重量%	グリセラート ^a (重量%)	界面活性剤 ^a (重量%)		SWS-131触媒 (C115)
		界面活性剤 ^a (重量%)	界面活性剤 ^a (重量%)	
リン酸三ナトリウム 15.35	41.63	Uteonite A05	21.34	—
リン酸三ナトリウム 23.33	0.63	—	26.34	0.45
ショウガカリウム・H ₂ O 34.13	—	—	25.34	—
硫酸ナトリウム 21.91	32.15	—	21.46	0.45
硫酸ナトリウム 21.19	30.40	—	24.40	—
クエン酸ナトリウム 31.17	0.95	—	25.43	0.45
プロピオニ酸ナトリウム 21.34	0.37	—	24.40	—
プロピオニ酸ナトリウム 26.33	0.81	—	24.40	0.45
四水クエン酸ナトリウム 18H ₂ O 44.24	37.31	—	14.61	—
亜硫酸ナトリウム 21.03	32.09	—	24.37	—
重碳酸ナトリウム 11.84	30.91	—	24.15	—
酢酸ナトリウム 24.04	0.11	—	26.79	1.49
二ナトリウム EDTA 2H ₂ O 0.54	37.91	—	24.46	—
四水硫酸ナトリウム 11.14	40.23	—	14.61	—
ショウガナトリウム 21.21	0.21	—	24.41	—
ショウガナトリウム 21.15	0.71	—	27.61	0.45
四水ホウ酸ナトリウム 6H ₂ O 36.64	0.51	—	22.37	0.45
酢酸アンモニウム 34.12	30.65	—	15.22	—
酢酸アンモニウム 21.81	0.31	—	24.46	—
リン酸三カリウム 35.65	41.61	—	24.21	0.45

バイオアッセイによりグリセラート試験活性に対する種々の試験条件の相対的貢献度を調べるために、水溶性粉末 (WSP) 試験物を調査した。本実験例では WSP 試験物の組成物を示す。

図表2

試験条件、重量%	グリセラート ^a (重量%)	界面活性剤 ^a (重量%)		SWS-131触媒 (C115)
		界面活性剤 ^a (重量%)	界面活性剤 ^a (重量%)	
硫酸ナトリウム 11.25	31.15	Uteonite A05	23.10	1.00
硫酸ナトリウム 11.84	30.91	—	21.10	0.45
オルトイ酢酸ナトリウム 18.20	30.81	—	24.34	—
オルトイ酢酸ナトリウム 14.34	31.10	—	24.40	—
ショウガナトリウム 21.21	0.71	—	25.49	—
ショウガナトリウム 31.61	24.21	—	24.31	0.50
水酸化ナトリウム (196) 14.44	31.23	—	14.57	0.44
水酸化ナトリウム (196) 14.44	31.23	—	31.23	—

* Uteonite A05 液体試験物を充填し、粉末化した。示したバーセンテージは試験物質に該するものである。
 ** Uteonite A05 はドライ状である。この界面活性剤の底液試験液に充填された。
 *** 10%、—及び二ナトリウム EDTA は水に不溶性である；したがって、グリセラートを可溶化するには四ナトリウム EDTA の 2 当量だけが用い得る。二ナトリウム EDTA を酸化剤として用いることは可溶化が得られない。

* Uteonite A05 の底液試験液。
 ** 不溶性チャリヤー上のシリコーン試験液。

実施例 8

実施例 2 の処方物のバイオアッセイ試験の結果を以下に示す。
ラウンドアップ除草剤を従来技術の比較例として用いた。処方物 A と処方物 I の結果を比較すると、酸アソニウム (A-S) の有効性が示される。

本明細書で示した通常バイオアッセイ試験のすべてにおいて、約 30 ppm (21 キロパスカル) で約 20 ガロン/エイカー (18.7 リットル/ヘクタール) を適用するよう度量りしたトラックスプレーを用いて、除草剤除草剤にグリセート WSP 処方物の水性溶液を噴霧した。

実施例 9

いくつかの水溶性除草剤除草剤処方物の生物学的評価

処方物	処方	結果
比較	セイパンモロコシ	51.9
A	HCOONa	11.3
B	CH ₃ COONa	11.3
C	Na ₂ CO ₃	11.8
D	Na ₂ SO ₃	11.1
E	Na ₂ PO ₄	14.4
F	CH ₃ CH ₂ COONa	11.1
G	K ₂ PO ₄	11.1
H	Na ₂ B ₄ O ₇	1.1
I	HCOONa (NH ₄) ₂ SO ₄	11.1
J	HCOONa NH ₄ Cl	1.1
K	(COONa) ₂	11.1
O	Na ₄ EDTA	11.1
P	未処理	1

* 処理後 4 週間の結果としてのセイパンモロコシ (okra) 上での 4 つの割合 (1/8, 1/4, 1/2 及び 1 ポンドのグリセート/エイカー) の平均。

実施例 4

グリセート活性に及ぼす種々の陰イオンの作用を測定するために、Witconate 間接活性剤を用いて WSP 処方物を調製した。界面活性剤は、バイオアッセイのために噴霧溶液中にタンク混合した。以下の実施例 5 は界面活性剤エトキシル化アルキルアミンを、実施例 6 は Witconate AOS を用いた結果を示す。

実施例 4

成分	処方量 (g)											
	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
グリセート (14.6)	70.41	14.41	70.37	14.39	71.17	62.77	65.11	52.51	61.21	24.41	24.71	61.31
WSP Q-31												
A. 鹽酸ナトリウム	1.00											
B. 鹽酸ナトリウム	31.19											
C. フロビオイン酸ナトリウム												
D. リン酸ナトリウム												
E. リン酸ナトリウム												
F. リン酸ナトリウム (10%)												
G. リン酸ナトリウム (10%)												
H. 四水クエン酸ナトリウム・4H ₂ O												
I. 四水クエン酸ナトリウム												
J. リン酸カリウム												
K. シュウ酸ナトリウム												
L. 四ナトリウム EDTA												
グリセート (10%)												

実施例 5

約 1/5-約 1/8 の範囲のエトキシル化度を有するエトキシル化アミン界面活性剤を用いた WSP 処方物 (陰イオン)

処方量	結果 (%) *
グリセートのイソプロピルアミン塩	55.2
硫酸ナトリウム	27.5
硫酸ナトリウム	38.8
炭酸ナトリウム	36.7
リン酸ナトリウム	56.3
亜硫酸ナトリウム	47.1
プロピオン酸ナトリウム	47.9
リン酸カリウム	62.1
四水クエン酸ナトリウム	30.8
酢酸カリウム	54.2
水酸化ナトリウム	45.8
ショウ酸ナトリウム	48.3
四ナトリウム EDTA	87.1
未処理チェック	0

* 処理後 4 週間のセイパンモロコシ上での 4 つの割合 (1/4, 1/2, 3/4 及び 1 ポンド グリセート/エイカー (0.28, 0.56, 0.84 及び 1.12 kg/ha)) の平均。

** 全噴霧溶液中に 0.25% エトキシル化アミン界面活性剤が存在する。

エトキシル化アミン界面活性剤 (実施例 5) と実施例 3 のものとのバイオアッセイ結果の比較により、因習が界面活性剤に大いに依っていることが示された。

実験例 9

市販の水性ラウンドアップ処方物より優れたグリセートWSP処方物の重要な利点は、前記に列挙した実験を含めた固体過剰剤を緩和する能力である。水不溶性液体緩和剤は、少量で又はキャリヤーに吸着させて用いてもよい。実験例9はさらに複数の緩和剤を含有するWSPと組み合わせた添加剤の多様の例を示す。

実験例 9	組成物合計グリセート-WSP			耐薬性(%)
	組成物(%)	緩和剤(%)	グリセート(11.6%)	
組成アンセニウム 16.14 水酸化ナトリウム 16.14 チオ硫酸ナトリウム 58.8 リン酸三カリウム 7.54 リン酸ナトリウム 4.62 リン酸三ナトリウム 6.12 硫酸ナトリウム 4.12 水酸化ナトリウム 0.60 硫酸アンモニウム 5.15 硫酸・H ₂ O 12.14	16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14	16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14 16.14	11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65	11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65 11.65
セリロジン HR 6.31 ビロコネート AOK 6.44 セリロジン HR 6.44	6.31 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44	6.31 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44	6.31 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44	6.31 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44 6.44

H, S臭は、生産されたチオ硫酸の分解を示す。

++ 処方例は 11.6% WSP-110%緩和剤を示す。

*** 乾燥しての粉末を生成する。

グリセートWSPと水不溶性緩和剤の組み合せは、重曹水化緩和剤又はWDG処方物のような補助剤を用いて達成し得る。補助剤は液体又はWDGのような液体であって、その例としては、アラクロール、アトラジン、MON-097、デュアル、ゴール、ハイップ、活性剤等が挙げられる。固体緩和剤、例えばオウスト、グリン、ジケロン、シマジン、アトラジン、ウリー、クラッシャー等は、微細粉末としてWSPに混入し得る。分散剤は後者処方物中で有益である。

グリセートノアラクロール処方物は、水酸化ナトリウム及びWitconate AOK又はSellogen HRを基盤にしてアラクロール水分散性顕粒(6.7%)をグリセートWSPと配合することにより調製した。処方物を以下に示す：

成分	A	B
グリセート(15.18)	15.18	15.18
水酸化ナトリウム(7.68)	15.18	15.18
Witconate AOK(11.8)	15.18	-----
Sellogen HR(15.5)	-----	12.18

以下の配合物を調製し、40mlの水に加えて、攪拌し、小皿の50mlのネスラー試験管に注ぎ入れて、10回逆さにして、以下の結果を得た：

D. 1. 50g A 2. 00g WDG	E. 1. 63g B 3. 00g WDG	F. 3. 00 WDG	初期時間	24hr	48hr	96hr	168hr	256hr
			重量比	重量比	重量比	重量比	重量比	重量比
-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----
-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----
-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----

卷之三

Morwell B (1960)	Witconate KAS-10 (1960) - Wilco EXP 101-15 C, カリウムデシルスルホキート ナトリウムデシルスルホキート (1960) - ニトリルIPAM (Wilco EXP 101-1) から調製
Morwell DB (1960)	アルキルナフタレンスルホキートヒドロカルボキシレートの混合物
Morwell RPW (1960)	アルキルナフタレンスルホキートヒドロカルボキシレート
Morwell IP (1960)	ナトリウムソリソブロピルナフタレンスルホキート
Morwell M (1960)	ナトリウムモリソブリモリナフタレンスルホキート
Sellagene HR (1960)	ナトリウムソリソブロピルナフタレンスルホキート
Witconate KOA-9 (1960) - Wilco EXP 101-15 A, カリウムデシルアルファラテフロン ナトリウムデシルスルホキート (1960) - ニトリルIPAM (Wilco EXP 101-1) から調製	
Witconate KOA-10 (1960) - Wilco EXP 101-15 B, ナトリウムデシルアルファラテフロン	
Witconate KOA-11 (1960) - Wilco EXP 101-15 C, カリウムモリソブリモリナフタレンスルホキート	
Witconate KOA-12 (1960) - Wilco EXP 101-15 D (ナトリウムモリソブリモリナフタレンスルホキートの混合物)	
Witconate AOK (1960) - ナトリウムモリソブリモリナフタレンスルホキート/ヘキサシルホキサシルホキテ (Witconate AOSのフライゼン)	
Aerosol OTB (1960) - ナトリウムモリソブリモリナフタレンスルホキート/ヘキサシルホキテ レスポンT-11 (61) - ナトリウムM-オキカル-N-オキカルカバレー	

卷之二

WSP処方物とともに用いるためのドライ界面活性剤の生物学的評価

題 寶 (%) 1

界面活性剤処理#	シユウ酸ナトリウム#68	水酸化ナトリウム#688
Witconate AOK	61.7	24.4
Morwet B	35.0	13.3
Morwet DB	50.0	22.8
Morwet EFW	11.7	7.8
Morwet IP	43.7	21.1
Morwet M	16.1	15.6
Sellogen HR	42.2	13.3
Witco KAS-10	49.7	22.2
Witco C ₁₄ SO ₃ K	43.0	7.8
Witco C ₁₄ SO ₃ Na	22.8	12.2
Witco KAOS-10	49.4	27.2
Witco KAOS-18	40.0	47.8
Witco KAOS 14-16	57.8	27.2
未処理チェック	0	0

* 处理後4週間目のセイパンモロコシに対する3つの割合(1/4, 1/2, 1/4
ボンド・グリセート・エーカー(0.31, 0.51, 0.81kg/3kg))の平均。

＊＊ 金界面活性剤を加えて 100%純分で 1.5%の界面活性剤を生成した。

＊＊＊ 放散容体としてのショウ酸ナトリウムを基礎にした処方物に関する粗旨%。

＊＊＊＊ 飲食官能としての水酸化ナトリウムを基盤にした食方に問する国際会議。

實物 11

50メッシュ以下の成分から以下の主パッチを調製した。

成分	A	B
グリセート (11.5%)	11.18	15.41
ショウ酸ナトリウム	11.25	-----
水酸化ナトリウム (16%)	-----	11.11
	100.00	100.00
含まれるグリセート %	11.11	15.41

所重量の主バッヂ及び界面活性剤を加えて 2:1 の N-ホスホノメチルグリシン界面活性剤比とすることにより、種々の界面活性剤の有効性を比較するバイオアッセイのための液滴法を確立した。バイオアッセイ結果を実験例 1-2 に示す。

表 賽例 1-3

グリセート WSP 施用衡を野外試験するために界面活性剤として Witconate AOK 及び Sellogen HR を用いた。10か所の場所での加工作業完全ブロック計画を用いて 3 回取り揃えた 10 × 25 フィート (3.05 × 7.62 メートル) の野外試験プロットは、放牧場のグリセート濃度の 10 ガロン / エーカー (94 リットル / ヘクタール) の WSP の水性溶液を適用するために度量したトラクター取付噴霧器を用いて噴霧された。

野外試験した处方物の成分を以下に示す：

コード番号	試験結果	
	試験方法	試験活性剤
245	Witconate AOK	硫酸アンモニウム
246	Sellogen HR	硫酸アンモニウム
247	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
248	Sellogen HR	硫酸アンモニウム
249	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
250	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
251	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
252	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
253	硫酸ナトリウム	硫酸アンモニウム
312	Witconate AOS-12	硫酸アンモニウム

実験例14

野外試験地劣物の組成物を以下に示す:

コード番号	成 分	%	重量/グラム
245	グリホセート (15.1%)	51.79	1420.5
	硫酸ナトリウム	20.64	568.2
	Witconate AOK (10%)	27.57	756.0
246	グリホセート (15.1%)	49.08	1420.6
	硫酸ナトリウム	19.56	568.2
	Sellogen HR (15%)	31.36	907.4
247	グリホセート (15.1%)	54.18	1420.5
	硫酸ナトリウム (10%)	16.79	444.7
	Witconate AOK (10%)	28.84	756.0
248	グリホセート (15.1%)	51.28	1420.5
	硫酸ナトリウム (10%)	16.04	444.7
	Sellogen HR (15%)	32.73	907.4
249	グリホセート (15.1%)	16.36	1420.5
	硫酸ナトリウム (10%)	5.12	444.7
	Witconate AOK (10%)	8.71	756.0
	硫酸アンモニウム	69.81	6059.8
250	グリホセート (15.1%)	18.47	1420.5
	2, 4-D (10%)	32.43	2494.0
	Witconate AOK (10%)	34.95	2688.0
	硫酸ナトリウム (10%)	14.15	1088.0
251	グリホセート (15.1%)	10.33	1420.5
	2, 4-D acid (10%)	18.14	2494.0
	Witconate AOK (10%)	19.55	2688.0
	硫酸ナトリウム (10%)	7.91	1088.0
	硫酸アンモニウム	44.07	6059.8
252	グリホセート (15.1%)	23.85	1420.5
	Dicamba (10%)	18.54	1104.1
	Witconate AOK (10%)	45.18	2691.3
	硫酸ナトリウム (10%)	12.43	740.4
253	グリホセート (15.1%)	11.82	1420.5
	Dicamba (10%)	9.19	1104.1
	Witconate AOK (10%)	22.40	2691.3
	硫酸ナトリウム (10%)	6.16	740.4
	硫酸アンモニウム	50.43	6059.8
312	グリホセート (15.1%)	54.19	143.74
	硫酸ナトリウム (10%)	18.97	45.01
	Witconate AOS-12 (10%)	28.84	76.50

野外試験データの要約を実験例15及び16に示す。

Witconate AOS及び硫酸ナトリウムを基礎にしたWSPは市販の寄せ集め品 (Roundup) と等価である。硫酸ナトリウム/Witconate AOK/硫酸アンモニウムWSPは、寄せ集め品/硫酸アンモニウムタンクミックスと等価である。グリホセート/2, 4-D WSPはLandmasterより活性が低く、一方両劣物が硫酸アンモニウムを含有する場合にはそれらは等価であった。同様の結果が、ジカルバ系を用いて得られた。

実験例15

グリホセート水溶性粉末 (WSP) 劣物に関する野外試験結果

施用	対照 (%)	
	日本	米国
市販寄せ集め品 (比較として)	74	61
グリホセート/Sellogen Sellogen/硫酸ナトリウム WSP	71	59
グリホセート/AOK/ 硫酸ナトリウム WSP	79	66
グリホセート/ Sellogen/NaOH WSP	58	43
グリホセート/ AOK/NaOH WSP	69	58
寄せ集め/AS ^{**} (比較として)	82	75
グリホセート/ AOK/NaOH/AS WSP	82	77

* 多数の場所でのプロットの平均。

** 硫酸アンモニウムを寄せ集め品 (Roundup) のタンクミックスに加えた。

実験例16パッケージミックスWSP処方物に関する野外試験データ

品種	対照(%)	
	草本	広葉
LANDMASTER ¹¹	81	86
グリホセート/2, 4-D WSP	76	75
LANDMASTER/AS	84	89
グリホセート/2, 4-D/AS/WSP	84	90
MON-8778 ¹²	82	73
グリホセート/DICAMBA WSP	73	58
MON 8778/AS	84	79
グリホセート/DICAMBA/AS WSP	83	79

* 多数の場所でのプロットの平均。

** グリホセート及び2, 4-Dの市販の水性処方物。

*** 水性ラウンドアップ除草剤/ジカムバタンクミックス。

実験例17

以下の処方にしたがって、プレミックス粉末処方物を調製した：

成 分	重量(%)	重量%
Filter-1酸(ドリケン酸) 34.75%	6185.1	62.03
重碳酸ナトリウム	3115.1	31.43
重碳酸ナトリウム	10.0	1.00
Soy 47 原油剤	10	1.00
PEG 3350	100.0	1.00
Carboxyl 1150		
計	10000.0	100.00

グリホセート酸は実質的に未反応であった。これは、本発明の処方物に水が添加されない場合には、グリホセートがグリホセート酸として植物に適用されることを意味する。水が加えられると、グリホセートは酸受容体と反応して、グリホセート酸が生成されると考えられる。

先ずプレミックス粉末をChilsonatorと呼ばれるローラー圧縮機を用いてウエファー形状に圧縮することにより、このプレミックス粉末を水溶性顆粒(WSC)に

處理加工した。このローラー圧縮機は約4000ポンド/平方インチ(27.6×10^3 キロパスカル)の圧力を用いた。このChilsonatorから得られたウエファーを次に、Straub 48粉砕機(穀物用ミルに似ているが、Filterミルが肝ましい)を用いて約12メッシュ又はそれを水滴に粉碎した。Straub粉砕装置に依り得られた粉末をふるい分けし、Chilsonatorに再循環させた。所望量の顆粒が生成されるまで、Chilsonator及びStraub粉砕機を用いた処理を繰り返した。

今説明した工程で調製された粉末をホッパーに送り込み、次に容量供給系を用いてダイ/パンチ/成形配列に送り込んでタブレットを調達した。パンチとダイに圧力をかけて、タブレットを調達した。圧力を取り除いてタブレットを取り出した。タブレットは重さ約4.6グラム±0.2グラムであった。タブレットは直径約0.75インチ(1.91cm)、高さ約0.5インチ(1.27cm)であった。この方法を用いて、異なる重量及び形状のタブレットを調達することもできる。

実験例18

グリホセート酸原体(4.8% w/w)、Doddigen 4022として公知のプロポキシル化第四アンモニウム界面活性剤(1.5% w/w)、9.7%及び硫酸アンモニウム(3.0% w/w)を、均質ドウが得られるまで、逆置型ミキシング装置で混合物する。次に重碳酸ナトリウム(1.2% w/w)をドウに加え、これを迅速に均質化して、押出機により直ちにペレット化し、その後筒床乾燥機で乾燥させる。押出工程後に得られた押出颗粒の最終成物は、1% w/wの水を含有する。

押出颗粒を、水を加えた噴霧タンクに入れる。次に重碳酸ナトリウムでグリホセートを中和し、溶液中にCO₂を放出させて発泡すると、押出颗粒は外部圧押しなくとも1分未満で溶解する。比較のために、溶解性を有さない同様の颗粒を外圧押せないと実際に溶解せず、液体下では溶解に2~4分を要し、実際に要する時間は噴霧タンク中の乱流に依っている。

これらのグリホセートWSP処方物の重要な利点は、固体表面活性剤を緩和する能力である。最も重要な固体表面活性剤の1つは、重量の所要のレベルでWSPに含有され得る硫酸アンモニウム

である。硫酸アンモニウムは、実施例15及び16に示したように、生物学的活性の増大に寄与する。硫酸アンモニウムは水性グリセート／界面活性剤方物中では低度に相溶性であるに過ぎない。硫酸アンモニウムはさらに、実施例16に示すように水溶性塩を生成する硫酸塩剤とのグリセートWSPパッケージミックス中の有効な固体添加剤である。

本発明のWSP又はWSG生成物の粒子サイズは、噴霧によらず適用前に生成物が完全に溶解する限り変化し得る。グリセートWSPの好みしい製造方法は、慣用的装置を用いて個々の成分を粉砕し、リオシン又はV-配合物のような装置を用いて配合するか又は配合成分を粉砕することを包含する。多数の界面活性剤及びいくつかの歯受容体は非常に吸湿性であるため、全量作は、好ましくは密閉装置中で実施し、ポリエチレン又はポリエチレン製紙袋等のような防水性パッケージングを要する。特に好みしい複数のパッケージングは、外部防水性容器又は袋に入れた水溶性袋である。

所望により、本発明の粉末化物質を実施例17でさらに例証するように個々の手段により圧縮し、次いで粉砕してふるいにかけて、粒状物質を生成し得る。気体生成成分を混入してさら

に迅速に崩壊させて粒状物質の崩壊を作る。

所望により、重炭酸カリウム、硫酸ナトリウム又カリウム、その混合物等、あるいはアルカリ土類金属の炭酸塩又は重炭酸塩、その混合物等のような別の炭酸塩を用いてもよい。

所望により、重硫酸カリウム又はアルカリ土類金属の重硫酸塩のような別の重硫酸塩を用いてもよい。

個々の分子量のPBG、ステアリン酸メチル又はステアリン酸マグネシウム、その混合物等を含めた別の崩壊剤を用いてもよい。AntiFogTM 30-INDのような別の崩壊剤を用いてもよい。

所望によりPVPのような結合剤を用い得るが、このような使用は任用である。

WSG処方物中に少ないパーセンテージの表面物ベースの歯受容体（重炭酸ナトリウム／硫酸ナトリウム、重硫酸アンモニウム、その混合物等）を用いると、崩壊を破壊させて爆発となる割合を増大する二重化炭素を水の存在下で発生させる。

本発明のWSP又はWSG組成物は各成分の比率に開通して大きく変化し得る。界面活性剤を用いる場合は、約4:1～約1:2のグリセート／界面活性剤比が好みしい範囲である：

1:0を含む他の比は、界面活性剤の存在が必要でないか又は望ましくない場合に用い得る。グリセート対歯受容体の比率は、表1に示した歯受容体の有効当量重量に依っている。グリセートの溶度を提供するには、1モルのグリセートに対して1有効当量の歯受容体が必要である。市販のグリセートにおける歯受容物はわずかな余分を要するため、通常、2～5%余分の歯受容体を用いる。グリセートは2.5で約1.0重量%の程度まで水に可溶性であるため、WSP又はWSGの使用に依り、即ち噴霧に用いる水の容量に依って、理論量未満の有効当量の歯受容体で十分である。WSP及びWSG処方物は一般に、圧力及び／又は回旋運動による有効な影響を受けない。前記のように、いくつかの成分、特に界面活性剤の吸湿性のために、水分はドライグリセート処方物の処理加工及び貯蔵における主要因心事である。

歯車を枯死又は制御するためにドライグリセート含む処方物を用いて本方法を実施する場合、最良の方法は、歯車剤の有効量の本発明の組成物を水に添加し、その後噴霧又は多数の公知の噴霧機の1つにより枯死又は制御すべき薬物の場所に適用することを包含する。過剰の薬が残りた植物に適用する場合に

は水の添加は必要ない（が、添加することを推奨する）。本発明の組成物の適用は、植物が除草剤的有効量のN-キスホノメルグリシンと接触するように行う。

多数の歯受容体が本発明では使用可能であるが、しかしシウ酸ナトリウム及び重炭酸ナトリウムが好みしく、重炭酸ナトリウムが最も好みしい。

多数の固体界面活性剤をグリセートWSP又はWSGに用い得るが、しかしナトリウムテトラデシル／ヘキサデシルアルファーオレフィンスルホネート（Wetconate AOK）が好みしい。低界面活性剤含量、即ち約2～5%含量の処方物では、グリセート活性に及ぼす高増強作用により、液体エトキシル化酸化アミン界面活性剤が好みしい。プロオキシル化四アンモニウム界面活性剤を用いる場合、1.5重量%まで使用できる。

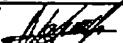
要約すると、一般的の水性処方物より優れたドライグリセートベースの処方物の利点としては、高活性物（グリセート）含量、固体又は水不溶性被体添加剤との相溶性、粉末又は水溶性顆粒のような固体及び液体水不溶性除草剤との相溶性、低コストパッケージの使用、及び最終市販製品の配合前にグリセ

セートを製造する必要性がないことが挙げられる。

本発明を特許の範囲に関して説明しておたが、その詳細は限定されるものではなく、図々の等価物、変更及び修正は、本発明の精神及び範囲を逸脱しない限りにおいて行われることは明らかである。このような等価の態様は本発明の範囲内に含まれるものと理解される。

国際特許報告

PCT/US 92/00274

I. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		International Application No. PCT/US 92/00274	
In which classification does the subject matter fall?		Classification System	
According to International Patent Classification (IPC) or to both National Classification and IPC		Classification System	
Int.Cl. 5 A01N7/20 // (A01N7/20, 25/14, 25/12)			
II. FIELDS SEARCHED			
Patent Document Searcher			
Classification System		Classification System	
Int.Cl. 5		A01N	
Information disclosed after the International Publication Date of the Patent Document is available in the Patent Document			
III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT*			
Category		Classification of References, 11th edition, where appropriate, of the relevant passage	
X		WORLD PATENTS INDEX LATEST Week 8736, 1 August 1990 Derwent Publications Ltd., London, GB; AU 87-253854 & JP-A, 62 176 408 (ISHINAKA SANKEI KAISHA) see abstract	
X		WO-A-P 007 275 (PENSANTO COMPANY) 12 July 1990 see examples 6, 10-23 see claims	
X		EP-A-0 360 441 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 28 March 1990 see page 8, line 40 see page 16, line 24 - line 27 see claims 3-10	
Information disclosed in each document is:			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which may relate directly or indirectly to the International Application, but is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which may relate directly or indirectly to the International Application, and is considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
- A general description of the subject matter of the document which is not considered to be of particular interest			
IV. CERTIFICATION			
Date of the Joint Committee of the International Bureau		Date of Meeting of the International Bureau	
19 MAY 1992		23.06.92	
Name and Position of the Examining Authority		Signature of Examining Officer	
EUROPEAN PATENT OFFICE		DALAFOURKI A. 	

International Application No. PCT/US 92/00274			
Classification of References, 11th edition, where appropriate, of the relevant passage			
X		EP-A-0 387 165 (RHONE-POULENC AGROCHIMIE) 12 September 1990 see page 5; examples 4,5	
		3-22	

国際特許報告

US 9200274
SA 57070

This section lists the patent family documents referred to in the present document that is, the above-mentioned International Patent Report. The numbers are as contained in the European Patent Office (EPO) file on The European Patent Office is in no way liable for those numbers which are merely given for the purpose of information. 19/05/92

Patent Document which is search report	Publication Date	Patent Family Number(s)	Publication Date
WO-A-9007275	12-07-90	AU-A- 4433300 CA-A- 2006616 EP-A- 0378985 EP-A- 0452366	01-08-90 30-08-90 25-07-90 23-10-91
EP-A-0360441	28-03-90	AU-A- 4193589 EP-A- 0432200 JP-T- 4500515 WO-A- 9002486	02-04-90 19-06-91 30-01-92 22-03-90
EP-A-0387165	12-09-90	FR-A- 2440316 AU-A- 5078990 CA-A- 2011531 JP-A- 2289505	14-09-90 20-09-90 07-09-90 29-11-90

REVIEW AND APPROVAL
BY THE
EXAMINER
IN THE
EXAMINING
DIVISION
OF THE
EUROPEAN
PATENT
OFFICE

フロントページの続き

(81) 指定国 EP(AT, BE, CH, DE,
DK, ES, FR, GB, GR, IT, LU, MC, N
L, SE), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM
, GA, GN, ML, MR, SN, TD, TG), AU
, BB, BG, BR, CA, CS, FI, HU, JP,
KP, KR, LK, MG, MN, MW, NO, PL, R
O, RU, SD